

特 許 協 力 条 約

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

（法第12条、法施行規則第56条）  
〔PCT36条及びPCT規則70〕

REC'D 17 JUN 2004

WIPO

PCT

出願人又は代理人 の書類記号 03P00052WO	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP03/10212	国際出願日 (日.月.年) 11.08.2003	優先日 (日.月.年) 13.08.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl. <sup>7</sup> C07D215/48, 401/04, 401/06, 401/12, 405/12, 413/04, 417/06, 471/04, 491/052, 413/06, 417/12, 409/12, A61K31/47, 31/4709, 31/496, 31/5377, 31/4375, 31/553, 31/541, A61P31/18, 37/04, 43/00		
出願人 (氏名又は名称) 塩野義製薬株式会社		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。  
法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。

2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 7 ページからなる。

3. この報告には次の附属物件も添付されている。

a ☐ 附属書類は全部で ページである。

☐ 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙（PCT規則70.16及び実施細則第607号参照）

☐ 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙

b ☐ 電子媒体は全部で (電子媒体の種類、数を示す)。  
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するデータを含む。（実施細則第802号参照）

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

☒ 第I欄 国際予備審査報告の基礎

☐ 第II欄 優先権

☒ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成

☐ 第IV欄 発明の単一性の欠如

☒ 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明

☒ 第VI欄 ある種の引用文献

☐ 第VII欄 国際出願の不備

☒ 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 02.02.2004	国際予備審査報告を作成した日 27.05.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 根本 佳子子	4P 9638
電話番号 03-3581-1101 内線 3492		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

## 第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、\_\_\_\_\_語による翻訳文を基礎とした。  
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査  
☐ PCT規則12.4にいう国際公開  
☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に应答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____	ページ、	出願時に提出されたもの
第 _____	ページ*、	付けて国際予備審査機関が受理したもの
第 _____	ページ*、	付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____	項、	出願時に提出されたもの
第 _____	項*、	PCT19条の規定に基づき補正されたもの
第 _____	項*、	付けて国際予備審査機関が受理したもの
第 _____	項*、	付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____	ページ/図、	出願時に提出されたもの
第 _____	ページ/図*、	付けて国際予備審査機関が受理したもの
第 _____	ページ/図*、	付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

<input type="checkbox"/> 明細書	第 _____	ページ
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項
<input type="checkbox"/> 図面	第 _____	ページ/図
<input type="checkbox"/> 配列表(具体的に記載すること)	_____	
<input type="checkbox"/> 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)	_____	

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

<input type="checkbox"/> 明細書	第 _____	ページ
<input type="checkbox"/> 請求の範囲	第 _____	項
<input type="checkbox"/> 図面	第 _____	ページ/図
<input type="checkbox"/> 配列表(具体的に記載すること)	_____	
<input type="checkbox"/> 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)	_____	

\* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

## 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 36

理由:

☒ この国際出願又は請求の範囲 36 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 36 は手術又は治療による人体の処置方法であり、この国際予備審査機関が国際予備審査をすることを要しない対象に係るものである。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 36 について、国際調査報告が作成されていない。

☐ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

- |                          |                |
|--------------------------|----------------|
| <input type="checkbox"/> | 提出されていない。      |
| <input type="checkbox"/> | 所定の基準を満たしていない。 |
| <input type="checkbox"/> | 提出されていない。      |
| <input type="checkbox"/> | 所定の基準を満たしていない。 |

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

- |                          |                    |
|--------------------------|--------------------|
| <input type="checkbox"/> | 提出されていない。          |
| <input type="checkbox"/> | 所定の技術的な要件を満たしていない。 |

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

## 第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性(N)

請求の範囲 3-27, 29-35, 37-41 有  
請求の範囲 1, 2, 28 無

進歩性(IS)

請求の範囲 有  
請求の範囲 1-35, 37-41 無

産業上の利用可能性(IA)

請求の範囲 有  
請求の範囲 1-35, 37-41 無

## 2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

## (文献)

1. DE 2539664 A (SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED) 1976.03.18
2. WO 02/30426 A1 (MERCK & CO., INC.) 2002.04.18
3. WO 02/30930 A2 (MERCK & CO., INC.) 2002.04.18
4. WO 02/36734 A2 (MERCK & CO., INC.) 2002.05.10

## (説明)

## ・請求の範囲1、2及び28について

請求の範囲1、2及び28に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献1から新規性及び進歩性を有しない。

文献1の実施例147には、請求の範囲1に記載の一般式(I)で表される化合物が記載されており、さらに、当該化合物を抗菌剤として用いることも記載されている。

また、請求の範囲1、2及び28に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献2～4より進歩性を有しない。

文献2～4には、請求の範囲1に記載の一般式(I)で表される化合物を包含する化合物群がHIVインテグラーゼ阻害作用を有することが記載されているから、上記化合物群に包含される化合物や、その環構造や置換基を適宜変換した化合物を実際に製造し、そのHIVインテグラーゼ阻害作用を確認してみることは、当業者であれば容易に想到し得たものである。

(補充欄に続く)

第VI欄 ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 02/70486 A1 [EX]	12. 09. 2002	27. 02. 2002	01. 03. 2001

2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

## 第Ⅷ欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲 1 に記載の一般式 (I) で表される化合物は、非常に多数の化合物を包含している。しかしながら、PCT 6 条の意味において明細書に裏付けられ、PCT 5 条の意味において開示されているのは、 $R^1$  が式  $-Z^1-Z^2-Z^3-R^5$  であり、 $B^1$  が  $-C(R^2)=$  であるような、ごく限られた部分にすぎない。

## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

## 第 V 欄の続き

## ・請求の範囲 3～27、29～35及び37～41について

請求の範囲 3～27、29～35及び37～41に係る発明は、国際調査報告で引用された何れの文献にも開示されておらず、新規性を有するが、国際調査報告で引用された文献 2～4 より進歩性を有しない。

文献 2～4 には、請求の範囲 3～7 や 14～27 に記載される化合物を包含する化合物群が HIV インテグラーゼ阻害作用を有することが記載されているから、上記化合物群に包含される化合物や、その環構造や置換基を適宜変換した化合物を実際に製造し、その HIV インテグラーゼ阻害作用を確認してみることは、当業者であれば容易に想到し得たことである。また、その製造方法も、当該技術分野において公知の方法から、当業者が適宜選択し得たものである。

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/JP2003/010212



PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY  
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference 03P00052WO	<b>FOR FURTHER ACTION</b>		See Form PCT/IPEA/416
International application No. PCT/JP2003/010212	International filing date (day/month/year) 11 August 2003 (11.08.2003)	Priority date (day/month/year) 13 August 2002 (13.08.2002)	
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 215/48, 401/04, 401/06, 401/12, 405/12, 413/04, 417/06, 471/04, 491/052, 413/06, 417/12, 409/12, A61K 31/47, 31/4709, 31/496, 31/5377, 31/4375, 31/553, 31/541, A61P 31/18, 37/04, 43/00			
Applicant SHIONOGI & CO., LTD.			

- This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.
- This REPORT consists of a total of 7 sheets, including this cover sheet.
- This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:
  - ☐ (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of \_\_\_\_\_ sheets, as follows:
    - ☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).
    - ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.
  - ☐ (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) \_\_\_\_\_, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).
- This report contains indications relating to the following items:
  - ☒ Box No. I Basis of the report
  - ☐ Box No. II Priority
  - ☒ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
  - ☐ Box No. IV Lack of unity of invention
  - ☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
  - ☒ Box No. VI Certain documents cited
  - ☐ Box No. VII Certain defects in the international application
  - ☒ Box No. VIII Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 02 February 2004 (02.02.2004)	Date of completion of this report 27 May 2004 (27.05.2004)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.



## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2003/010212

## Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

- ☐ This report is based on translations from the original language into the following language \_\_\_\_\_, which is language of a translation furnished for the purpose of:
- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
  - ☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
  - ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

- ☒ The international application as originally filed/furnished
- ☐ the description:  
pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished  
pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_  
pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☐ the claims:  
pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished  
pages\* \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement) under Article 19  
pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_  
pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings:  
pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished  
pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_  
pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

\* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP03/10212

**Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability**

The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

☐ the entire international application.

☒ claim No. 36

because:

☒ the said international application, or the said claim No. 36  
relates to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (*specify*):

The subject matter of claim 36 pertains to a method for treatment and diagnosis of the human body by surgery or therapy which does not require an international preliminary examination by the International Preliminary Examining Authority.

☐ the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. \_\_\_\_\_  
are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

☐ the claims, or said claims Nos. \_\_\_\_\_ are so inadequately supported  
by the description that no meaningful opinion could be formed.

☒ no international search report has been established for said claim No. 36

☐ the nucleotide and/or amino acid sequence listing does not comply with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions in that:

the written form

☐ has not been furnished

☐ does not comply with the standard

the computer readable form

☐ has not been furnished

☐ does not comply with the standard

☐ the tables related to the nucleotide and/or amino acid sequence listing, if in computer readable form only, do not comply with the technical requirements provided for in Annex C-*bis* of the Administrative Instructions.

☐ see Supplemental Box for further details.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP03/10212

**Box No. V** Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

## 1. Statement

Novelty (N)

Claims 3-27, 29-35, 37-41 YES

Claims 1, 2, 28 NO

Inventive step (IS)

Claims YES

Claims 1-35, 37-41 NO

Industrial applicability (IA)

Claims YES

Claims 1-35, 37-41 NO

## 2. Citations and explanations (Rule 70.7)

## Documents

1. DE, 2539664, A (Sumitomo Chemical Company, Limited), 18 March, 1976
2. WO, 02/30426, A1 (Merck & Co., Inc.), 18 April, 2002
3. WO, 02/30930, A2 (Merck & Co., Inc.), 18 April, 2002
4. WO, 02/36734, A2 (Merck & Co., Inc.), 10 May, 2002

## Explanation

Re: claims 1, 2 and 28

The inventions described in claims 1, 2 and 28 do not appear to be novel or to involve an inventive step based on document 1 cited in the ISR.

Document 1 (example 147) describes a compound represented by General Formula (I) of claim 1 and it also describes using said compound as an antibacterial agent.

Furthermore, the inventions described in claims 1, 2 and 28 do not appear to involve an inventive step based on documents 2-4.

Documents 2-4 describe a group of compounds including the compound represented by General Formula (I) of claim 1, which has HIV integrase inhibitory activity; actually producing a compound included in the aforementioned group of compounds and a compound in which ring structure and substituent are appropriately converted, and confirming the HIV integrase inhibitory activity thereof is something that a party skilled in the art can easily conceived of.

(Continued)

# INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP03/10212

## Box No. VI Certain documents cited

### 1. Certain published documents (Rule 70.10)

Application No. Patent No.	Publication date (day/month/year)	Filing date (day/month/year)	Priority date (valid claim) (day/month/year)
WO 02/70486 A1	12.09.2002	27.02.2002	01.03.2001

### 2. Non-written disclosures (Rule 70.9)

Kind of non-written disclosure	Date of non-written disclosure (day/month/year)	Date of written disclosure referring to non-written disclosure (day/month/year)

**Box No. VIII Certain observations on the international application**

The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

The compounds represented by General Formula (I) described in claim 1 include an extremely large number of compounds. However, compounds fully supported by the specification in the sense of PCT Article 6, and disclosed in the sense of PCT Article 5 are only those compounds having  $R^1$  being represented by Formula  $-Z^1-Z^2-Z^3-R^5$  and  $B^1$  being represented by Formula  $-C(R^2)=$ , which comprise only a small portion of the compounds of claim 1.

## Supplemental Box

In case the space in any of the preceding boxes is not sufficient.  
Continuation of Box V:

Re: claims 3-27, 29-35 and 37-41

The inventions relating to claims 3-27, 29-35 and 37-41 are not described in any of the documents cited in the ISR and while they appear to be novel, they do not appear to involve an inventive step based on documents 2-4.

Documents 2-4 describe a group of compounds that include the compounds described in claims 3-7 and 14-27 having HIV integrase inhibitory activity. Actually producing a compound included in the aforementioned group of compounds and a compound in which ring structure and substituent are appropriately converted, and confirming the HIV integrase inhibitory activity thereof is something that a party skilled in the art can easily conceived of. Furthermore, the production method therefor can be appropriately selected by a party skilled in the art based on publicly known methods available in the relevant technical field.